Application Number: 10/631,029

Filing Date: 07/29/2003

First Named Inventor: Rajinder Singh Attorney Docket Number: 064311-1602

Identifier: F1

N-(2-nitrophenyl)-4-aminopyrimidine derivatives, their preparation and use.

Publication number: EP0139613
Publication date: 1985-05-02

Inventor: HIRF

HUBELE ADOLF DR; ECKHARDT WOLFGANG DR;

STURM ELMAR DR; ZONDLER HELMUT DR

Applicant: CIBA GEIGY AG (CH)

Classification:

- International: A01N43/54; C07D239/42; C07D239/46; C07D239/47;

C07D239/48; C07D239/50; C07D239/52; C07D239/56; C07D401/12; C07D405/12; A01N43/48; C07D239/00; C07D401/00; C07D405/00; (IPC1-7): C07D239/47; A01N43/54; C07D239/28; C07D239/42; C07D239/46;

C07D239/48

- European: A01N43/54; C07D239/42B1; C07D239/42B3;

C07D239/42C2; C07D239/42C5; C07D239/46C3; C07D239/46C4; C07D239/48B1; C07D239/48C2; C07D239/48C3; C07D239/48C5; C07D239/52; C07D239/56C; C07D401/12; C07D405/12

Application number: EP19840810417 19840823 **Priority number(s):** CH19830004723 19830829

Also published as:

JP60072867 (A) ES8506288 (A) BR8404295 (A) PT79137 (B) GR80171 (B)

Cited documents:

EP0067630 EP0057440

Report a data error here

Abstract of EP0139613

There are described novel N-(2-nitrophenyl)-4-aminopyrimidine derivatives of the formula I in which R1 is NO2 or CF3; R2 is NO2 or CF3; R3 is hydrogen or halogen; R4 is hydrogen or the group -C(O)R7 where R7 is an unsubstituted or substituted radical from the series comprising C1-C12-alkyl, C2-C6-alkenyl, C3-C7-cycloalkyl, phenyl and heterocyclyl; R5, R6 and R8 independently of one another are halogen, cyano, rhodano, nitro or one of the groups -N(R9)(R10), -R11, R12-O- or R13-S(O)n where R9 and R10 independently of one another are hydrogen or an unsubstituted or substituted radical from the series comprising C1-C12- alkyl, C3-C6-alkenyl and phenyl, or jointly, together with the nitrogen atom, form an optionally substituted heterocyclic ring; n is one of the numbers 0, 1 or 2; R11, R12 and R13 independently of one another are an unsubstituted or substituted radical from the series comprising C1-C12-alkyl, C2-C6- alkenyl, C3-C6-alkynyl, C3-C7-cycloalkyl, phenyl or heterocyclyl; moreover R5 can represent hydrogen, R6 can represent hydrogen, or two of the radicals R5, R6 and R8 can represent hydrogen. There are further disclosed methods for the preparation of these products, and agrochemical compositions which contain one of these compounds as active substance. Their use in the agricultural sector and related areas is also described.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(11) Veröffentlichungsnummer:

0 139 613

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 84810417.0

(22) Anmeldetag: 23.08.84

(5) Int. Cl.4: C 07 D 239/47

C 07 D 239/42, C 07 D 239/46

C 07 D 239/48, C 07 D 239/28

A 01 N 43/54

30 Priorität: 29.08.83 CH 4723/83

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 02.05.85 Patentblatt 85/18

84) Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE (71) Anmelder: CIBA-GEIGY AG Postfach CH-4002 Basel(CH)

(72) Erfinder: Hubele, Adolf, Dr. Obere Egg 9 CH-4312 Magden(CH)

(72) Erfinder: Eckhardt, Wolfgang, Dr. **Breslauerstrasse 14** D-7850 Lörrach(DE)

(72) Erfinder: Sturm, Elmar, Dr. Klusstrasse 66 CH-4147 Aesch(CH)

(72) Erfinder: Zondler, Helmut, Dr. Oberwilerstrasse 49 CH-4103 Bottmingen(CH)

54 N-(2-Nitrophenyl)-4-aminopyrimidin-Derivate, deren Herstellung und Verwendung.

57) Es werden neue N(2-Nitrophenyl)-4-amino-pyrimidin-Derivate der allgemeinen Formel I beschrieben,

worin

R₁ für NO₂ oder CF₃ steht;

R₂ für NO₂ oder CF₃ steht;

R₃ Wasserstoff oder Halogen bedeutet;

R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe -C(O)R₇ steht; wobei R₇ einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl und Herterocyclyl repräsentiert;

R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(O)_n stehen, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander Wasserstoff oder einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C1-C12-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl und Phenyl darstellen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden;

n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet:

 R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Heterocyclyl stehen; darüberhinaus R₅ für Wasserstoff, R₆ für Wasserstoff oder zwei der Reste R₅, R₆ und R₈ für Wasserstoff stehen können.

Es werden ferner methoden zur Herstellung dieser Produkte offenbart sowie agrochemische Mittel, die als Wirkstoff eine dieser Verbindungen enthalten. Ferner wird ihr Einsatz auf dem Agrargebiet bzw. verwandten Gebieten beschrieben.

CIBA-GEIGY AG
Basel (Schweiz)

5-14567/=

N-(2-Nitrophenyl)-4-aminopyrimidin-Derivate, deren Herstellung und Verwendung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue N(2-Nitropheny1)-4-aminopyrimidin-Derivate der nachstehenden Formel I.

Die Erfindung betrifft ferner die Herstellung dieser Substanzen sowie agrochemische Mittel, die als Wirkstoff mindestens eine dieser Verbindungen enthalten. Die Erfindung betrifft ebenso die Herstellung der genannten Mittel sowie die Verwendung der Wirkstoffe oder der Mittel zur Bekämpfung von schädlichen Mikroorganismen, vorzugsweise pflanzenschädigenden Pilzen.

Bei den erfindungsgemässen Verbindungen handelt es sich um solche der allgemeinen Formel I:

$$R_{2} \xrightarrow{\text{NO}_{2}} R_{8} \xrightarrow{\text{R}_{6}} R_{6}$$

$$R_{1} \xrightarrow{\text{R}_{4}} N \xrightarrow{\text{R}_{5}} R_{5}$$
(1)

worin

R₁ für NO₂ oder CF₃ steht;

 R_2 für NO_2 oder CF_3 steht;

R, Wasserstoff oder Halogen bedeutet;

R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe -C(0)R₇ steht; wobei

R₇ einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl und Heterocyclyl repräsentiert;

- R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(O)_n stehen, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander Wasserstoff oder einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl und Phenyl darstellen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden;
- n eine der Zahlen O, 1 oder 2 bedeutet;
- R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Heterocyclyl stehen; darüberhinaus R₅ für Wasserstoff, R₆ für Wasserstoff oder zwei der Reste R₅, R₆ und R₈ für Wasserstoff stehen können.

Unter dem Begriff Alkyl selbst oder als Bestandteil eines anderen Substituenten, wie Alkoxy, Alkylmercapto, Haloalkyl, etc., sind je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome beispielsweise die folgenden geradkettigen oder verzweigten Gruppen zu verstehen: Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl, Undecyl, Dodecyl usw. sowie ihre Isomeren, wie z.B. Isopropyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Isopentyl usw. Die Vorsilbe Halo in der Bezeichnung eines Substituenten bedeutet hier und im folgenden, dass dieser Substituent einfach bis perhalogeniert auftreten kann. Ere ... Halogen und Halo stehen stellvertretend für F, Cl, Br oder J. Haloalkyl steht somit für einen einfach bis perhalogenierten Alkylrest, wie z.B. $CHC1_2$, CH_2F , $CC1_3$, CH_2C1 , CHF_2 , CH_2CH_2Br , C_2C1_5 , CHBrCl usw., vorzugsweise für CF3. Alkenyl steht z.B. für Propenyl-(1), Allyl, Butenyl-(1), Butenyl-(2) oder Butenyl-(3) sowie Ketten mit mehreren Doppelbindungen. Cycloalkyl steht je nach Zahl der genannten Kohlenstoffatome z.B. für Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl usw. Alkinyl bedeutet z.B.

Propinyl-(2), Propargyl, Butinyl-(1), Butinyl-(2) usw., vorzugsweise Propargyl.

Der Ausdruck "Heterocyclyl" oder "hererocyclischer Ring" soll hier und im folgenden für einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Rest mit einem oder mehreren Heteroatomen, vorzugsweise einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclus repräsentieren mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen, wie z.B. Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel. Typische Vertreter derartiger Heterocyclen sind: Tetrahydrofuran, Furan, Tetrahydrothiophen, Thiophen, Pyrrolidin, Pyrrol, Pyrrolin, Pyrazol, Imidazol, Pyrazolin, Oxazol, Thiazol, Isoxazol, Isothiazol, Pyran, Dihydropyran, Tetrahydropyran, Thiopyran, Dihydrothiopyran, Tetrahydropyridazin, Tetrahydropyridazin, Pyrimidin, Dihydropyrimidin, Tetrahydropyrimidin, Pyrazin, Dihydropyrazin, Tetrahydropyrazin, Morpholin, Thiazin, Dihydrothiazin, Tetrahydrothiazin, Piperazin und Triazin.

Die Verbindungen der Formel I sind bei Raumtemperatur Oele, Harze oder überwiegend kristalline Feststoffe, die sich durch sehr wertvolle pestizide Eigenschaften auszeichnen. Sie lassen sich beispielsweise auf dem Agrarsektor oder verwandten Gebieten präventiv und kurativ zur Bekämpfung phytopathogener Schädlinge, wie z.B. pflanzenpathogenen Pilzen einsetzen. Die erfindungsgemässen Wirkstoffe der Formel I zeichnen sich in weiten Anwendungskonzentrationen durch eine hohe pestizide Aktivität und grosse Wirkungsbreite aus und können problemlos, insbesondere im Agrarbereich eingesetzt werden.

Folgende Wirkstoffgruppen sind auf Grund ihrer ausgeprägten pestiziden, insbesondere pflanzenfungiziden Aktivität bevorzugt:

Gruppe Ia: Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Halogen bedeutet; R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe -C(0)R₇ steht; wobei R₇ unsubsti-

tuiertes oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C4-Alkenyl, C3-C6-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Phenyl oder einen unsubstituierten oder durch Halogen, C_1 - C_3 -Alkyl oder Nitro substituierten, ungesättigten oder gesättigten fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen repräsentiert; R_5 , R_6 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(Rq)(R10), $^{-R}_{11}$, $^{R}_{12}$ -0- oder $^{R}_{13}$ -S(0) n stehen, wobei $^{R}_{9}$ und $^{R}_{10}$ unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigten, unsubstituierten oder durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten, fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatome enthalten kann; n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder cyclische Rest Fig. 1945. Seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl; C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen, unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R_5 für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R_5 , R_6 und R_8 für Wasserstoff stehen können.

Gruppe Ib: Verbindungen der Formel I, worin R, für NO, oder CF, steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Halogen bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R_Q)(R₁₀), $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0)_n stehen, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₁₂-Alky1, C₃-C₆-Alkeny1, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigen, unsubstituierten oder durch Halogen, C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy substituierten, fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatome enthalten kann; n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C_1 - C_{12} -Alkyl, wobei jeder cyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C1-C1-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C_1-C_L -Alkoxy substituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen, unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R_5 für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R5, R6 und R8 für Wasserstoff stehen können.

Gruppe Ic: Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₅ für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R_9)(R_{10}), - R_{11} , R_{12} -O- oder R_{13} -S(O)_n steht, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C3-C4-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituierts oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes $^{\rm C}1^{-\rm C}12^{-\rm Alkyl}$, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiert ist; für C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₂-Alkyl, CF₃ oder $^{\mathrm{C_{1}^{-C_{2}^{-}Alkoxy}}}$ substituiertes Phenyl stehen; und $^{\mathrm{R}_{6}}$ und $^{\mathrm{R}_{8}}$ Wasserstoff bedeuten.

Gruppe Id: Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₅ für Wasserstoff steht; R₆ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(O)_n steht, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2 steht; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl oder unsubstituiertes

oder durch Halogen, CF $_3$, C $_1$ -C $_2$ -Alkyl oder C $_1$ -C $_2$ -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R $_8$ Wasserstoff bedeutet.

Gruppe Ie: Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄, R₅ und R₆ für Wasserstoff stehen; und R₈ Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-0- oder R₁₃-S(0)_n repräsentiert, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2 steht; und R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch Halogen, CF₃, C₁-C₂-Alkyl oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen.

Gruppe If: Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R_2 für NO_2 oder CF3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12}^{-0-} oder $R_{13}^{-S(0)}$ steht, wobei R_9 und R_{10}^{-0-} unabhängig voneinander für Wasserstoff, $C_1^{-C_4^{-Alky1}}$, $C_3^{-C_4^{-Alkeny1}}$, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Ring ausgewählt aus der Reihe Piperidin, Tetrahydrofuryl und Morpholin bilden; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für $C_3^{-C_4^{-Alkenyl}}$, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes $C_1^{-C}_{12}^{-Alkyl}$, wobei jeder heterocyclische

Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiert ist; für C_3 - C_4 -Alkinyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1 - C_2 -Alkyl, CF_3 oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_6 Wasserstoff bedeutet.

Gruppe Ig: Verbindungen der Formel I, worin R, für NO2 oder CF3 steht; R, für NO, oder CF, steht; R, Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R, für Wasserstoff steht; R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R_{12}^{-0-} oder $R_{13}^{-S}(0)$ steht, wobei R_9 und R_{10}^{-} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes c_1 - c_2 -Alkyl, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF3 oder Methoxy substituiert ist; für C3-C4-Alkinyl, C3-C6-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₂-Alkyl, CF₃ oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_5 Wasserstoff bedeutet.

Besonders bevorzugte Einzelsubstanzen sind z.B.:

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-chlor-pyrimidin (Nr. 2.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-methylmercapto-pyrimidin (Nr. 2.5);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-methoxypyrimidin (Nr. 2.4);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-(2,2,2-trifluorethoxy)-pyrimidin (Nr. 2.6);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylpheny1)-4-amino-2-methoxy-5-chlor-pyrimidin (Nr. 5.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2,5-dichlor-pyrimidin (Nr. 5.3);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-chlor-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.4);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methoxy-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.6);

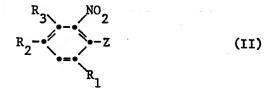
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 6.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-amino-pyrimidin (Nr. 6.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methyl-mercapto-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 7.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methyl-5-ethyl-6-chlor-pyrimidin (Nr. 7.3);

Die Verbindungen der Formel I werden erfindungsgemäss dadurch hergestellt, dass man eine Verbindung der Formel II



in Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III

$$\begin{array}{c}
R_8 \\
Y - \bullet \\
N - \bullet
\end{array}$$
(III)

zu einer Verbindung der Formel I'

$$R_{2} \xrightarrow{R_{0}} NO_{2} \qquad R_{8} \xrightarrow{R_{6}} N$$

$$R_{1} \qquad N_{1} \qquad R_{5} \qquad (I')$$

umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV

N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_8 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

Für die Herstellung der Verbindungen der Formel I bzw. I' sind folgende Reaktionsbedingungen vorteilhaft:

Die N-Alkylierung von (II) mit (III) zu (I¹), sowie die N-Acylierung von (I¹) mit (IV) zu (I) erfolgen unter Halogenwasserstoffabspaltung. Die Reaktionstemperaturen liegen bei der N-Alkylierung zwischen -20° und 150°C, vorzugsweise -20° und +30°C, bei der N-Acylierung zwischen 0° und +180°C, vorzugsweise 0° und 150°C bzw. am Siedepunkt des Lösungsmittels bzw. Lösungsmittelgemisches. In beiden Fällen ist die Verwendung von säurebindenden Mitteln bzw.

Kondensationsmitteln vorteilhaft. Als solche kommen organische und anorganische Basen in Betracht, z.B. tertiäre Amine wie Trialkylamine (Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin usw.), Pyridin und Pyridinbasen (4-Dimethylaminopyridin, 4-Pyrrolidylaminopyridin usw.), Oxide und Hydroxide, Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen sowie Alkaliacetate.

Die Reaktionen können in Anwesenheit von reaktionsinerten Lösungsoder Verdünnungsmitteln durchgeführt werden. In Frage kommen beispielsweise aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe wie
Benzol, Toluol, Xylole, Petrolether; halogenierte Kohlenwasserstoffe
wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Tetrachlorethylen; Ether und etherartige Verbindungen
wie Dialkylether (Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether usw.), Anisol, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril, Pripionitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid;
Dimethylsulfoxid; Ketone wie Aceton, Diethylketon, Methylethylketon
und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander. In manchen Fällen
kann das Acylierungs- oder Alkylierungsmittel selbst als Lösungsmittel dienen.

Die Reaktion (II) und (III) kann auch in einem wässrigen Zweiphasensystem nach dem allgemein bekannten Prinzip der Phasentransferkatalyse durchgeführt werden. Für die organische, mit Wasser nicht mischbare Phase kommen dabei z.B. folgende Lösungsmittel in Frage: Aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylole usw., halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ethylendichlorid, 1,2-Dichlorethan, Tetrachlorethylen usw. oder aliphatische Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, t-Butylmethylether usw.. Beispiele geeigneter Phasentransfer-Katalysatoren sind: Tetraalkylammoniumchlorid, -hydrogensulfate oder -hydroxide wie Tetrabutylammoniumchlorid, -bromid; Tetrapropylammoniumchlorid, -bromid, -jodid; usw.. Als Phasentransfer-Katalysatoren kommen auch Phosphonium-Salze in Betracht. Die Reaktionstemperaturen liegen im allgemeinen zwischen -30° und 130°C, bzw. am Siedepunkt des Lösungsmittels oder Lösungsmittelgemisches.

Im übrigen kann bei der Herstellung aller hierin genannten Ausgang-, Zwischen- und Endprodukte können grundsätzlich, sofern nicht ausdrücklich im einzelnen spezifiziert, ein oder mehrere reaktionsinerte Lösungs- oder Verdünnungsmittel anwesend sein. In Frage kommen beispielsweise aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylole, Petrolether; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Tetrachlorethylen; Ether und etherartige Verbindungen wie Dialkylether (Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether usw.), Anisol, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril, Propionitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid; Dimethylsulfoxid; Ketone wie Aceton, Diethylketon, Methylethylketon und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander. In

manchen Fällen kann es auch von Vorteil sein, wenn die Reaktion oder Teilschritte einer Reaktion unter Schutzgasatmosphäre und/oder absoluten Lösungsmitteln durchgeführt werden. Als Schutzgase eignen sich inerte Gase wie Stickstoff, Helium, Argon, usw..

Das beschriebene Herstellungsverfahren ist, einschliesslich aller Teilschritte, ein wichtiger Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

Es wurde überraschend festgestellt, dass Verbindungen der Formel I ein für praktische Bedürfnisse sehr günstiges biozides Spektrum gegen schädliche Mikroorganismen, insbesondere gegen phytopathogene Pilze aufweisen. Sie besitzen sehr vorteilhafte kurative, systemische und insbesondere präventive Eigenschaften und lassen sich zum Schutz von zahlreichen Kulturpflanzen einsetzen. Mit den Wirkstoffen der Formel I können an Pflanzen oder an Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen, Wurzeln) von unterschiedlichen Nutzkulturen die auftretenden Schädlinge eingedämmt oder vernichtet werden, wobei auch später zuwachsende Pflanzenteile vor phytopathogenen Mikroorganismen verschont bleiben.

Als Mikrobizide sind die Wirkstoffe der Formel I z.B. gegen die den folgenden Klassen angehörenden phytopathogenen Pilze wirksam: Fungi imperfecti (z.B. Botrytis, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora und Alternaria); Basidiomyceten (z.B. die Gattungen Hemileia, Rhizocotonia, Puccinia); insbesondere wirken sie gegen die Klasse der Ascomyceten (z.B. Venturia, Podosphaera, Erysiphe, Monilinia, Uncinula). Ueberdies wirken die Verbindungen der Formel I systemisch. Sie können ferner als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut (Früchte, Knollen, Körner) und Pflanzenstecklingen zum Schutz von Pilzinfektionen sowie gegen im Erdboden auftretende phytopathogene Pilze eingesetzt werden.

Die Erfindung betrifft somit auch mikrobizide Schädlingsbekämpfungsmittel sowie deren Verwendung auf den Agrarsektor oder verwandten Gebieten zur Bekämpfung von pathogenen Mikroorganismen, wie z.B. Pilzen.

Darüberhinaus schliesst die vorliegende Erfindung auch die Herstellung dieser Mittel ein, die gekennzeichnet ist durch das innige Vermischen der Aktivsubstanz mit einem oder mehreren hierin beschriebenen Substanzen bzw. Substanzgruppen. Eingeschlossen ist auch ein Verfahren zur Behandlung von Pflanzen, das sich durch Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der neuen Mittel auszeichnet.

Als Zielkulturen für den hierin offenbarten mikrobiziden Einsatz gelten im Rahmen dieser Erfindung beispielsweise folgende Pflanzenarten:

Getreide; (Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Reis, Sorghum und Verwandte); Rüben: (Zucker- und Futterrüben); Kern-, Stein- und Beeren- obst: (Aepfel, Birnen, Pflaumen, Pfirsiche, Mandeln, Kirschen, Erd-, Him- und Brombeeren); Hülsenfrüchte: (Bohnen, Linsen, Erbsen, Soja);

Oelkulturen: (Raps, Senf, Mohn, Oliven, Sonnenblumen, Kokos, Rizinus, Kakao, Erdnüsse); Gurkengewächse: (Kürbis, Gurken, Melonen); Faser- gewächse: (Baumwolle, Flachs, Hanf, Jute); Citrusfrüchte: (Orangen, Zitronen, Pampelmusen, Mandarinen); Gemüsesorten: (Spinat, Kopfsalat, Spargel, Kohlarten, Möhren, Zwiebeln, Tomaten, Kartoffeln, Paprika); Lorbeergewächse: (Avocado, Cinnamonum, Kampfer) oder Pflanzen wie Mais, Tabak, Nüsse, Kaffee, Zuckerrohr, Tee, Weinreben, Hopfen, Bananen- und Naturkautschukgewächse sowie Zierpflanzen (Compositen).

Wirkstoffe der Formel I werden üblicherweise in Form von Zusammensetzungen verwendet und können gleichzeitig oder nacheinander mit
weiteren Wirkstoffen auf die zu behandelnde Fläche oder Pflanze
gegeben werden. Diese weiteren Wirkstoffe können sowohl Düngemittel,
Spurenelement-Vermittler oder andere das Pflanzenwachstum beeinflussende Präparate sein. Es können aber auch selektive Herbizide,

Insektizide, Fungizide, Bakterizide, Nematizide, Molluskizide oder Gemische mehrerer dieser Präparate sein, zusammen mit gegebenenfalls weiteren in der Formulierungstechnik üblichen Trägerstoffen, Tensiden oder anderen applikationsfördernden Zusätzen.

Geeigente Träger und Zusätze können fest oder flüssig sein und entsprechen den in der Formulierungstechnik zweckdienlichen Stoffen, wie z.B. natürlichen oder regenerierten mineralischen Stoffen, Lösungs-, Dispergier-, Netz-, Haft-, Verdickungs-, Binde- oder Düngemitteln.

Ein bevorzugtes Verfahren zum Aufbringen eines Wirkstoffes der Formel I bzw. eines agrochemischen Mittels, das mindestens einen dieser Wirkstoffe enthält, ist das Aufbringen auf das Blattwerk (Blattapplikation). Anzahl der Applikationen und Aufwandmenge richten sich dabei nach dem Befallsdruck für den entsprechenden Erreger (Pilzsorte). Die Wirkstoffe der Formel I können aber auch über den Erdboden durch das Wurzelwerk in die Pflanze gelangen (systemische Wirkung), indem man den Standort der Pflanze mit einer flüssigen Zubereitung tränkt oder die Substanzen in fester Form in den Boden einbringt, z.B. in Form von Granulat (Bodenapplikation). Die Verbindungen der Formel I können aber auch auf Samenkörner aufgebracht werden (Coating), indem man die Körner entweder mit einer flüssigen Zubereitung des Wirkstoffs tränkt oder sie mit einer festen Zubereitung beschichtet. Darüberhinaus sind in besonderen Fällen weitere Applikationsarten möglich, so z.B. die gezielte Behandlung der Pflanzenstengel oder der Knospen.

Die Verbindungen der Formel I werden dabei in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmittel eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentraten, streichfähigen Pasten, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern, Stäubemitteln, Granulaten, durch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen,

Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Bestreichen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt. Günstige Aufwandmengen liegen im allgemeinen bei 50 g bis 5 kg Aktivsubstanz (AS) je ha; bevorzugt 100 g bis 2 kg AS/ha, insbesondere bei 200 g bis 600 g AS/ha.

Die Formulierungen d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C₈ bis C₁₂, wie z.B. Xylolgemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder Dioctylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Ether und Ester, wie Ethanol, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonomethyl- oder Ethylether, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxydierte Pflanzenöle wie epoxydiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talkum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kieselsäure oder hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt werden. Als gekörnte, adsorptive Granulatträger kommen poröse Typen wie z.B. Bimsstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z.B. Calcit oder Sand in Frage. Darüber-

hinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden. Besonders vorteilhafte, applikationsfördernde Zuschlagstoffe, die zu einer starken Reduktion der Aufwandmenge führen können, sind ferner natürliche (tierische oder pflanzliche) oder synthetische Phospholipide aus der Reihe der Kephaline und Lecithine, wie z.B. Phosphatidylethanolamin, Phosphatidylserin, Phosphatidylcholin, Sphingomyelin, Phosphatidylinosit, Phosphatidylglycerin, Lysolecithin, Plasmalogene oder Cardiolipin, die man beispielsweise aus tierischen oder pflanzlichen Zellen, insbesondere aus Hirn, Herz, Leber, Eidotter oder Sojabohnen gewinnen kann. Verwendbare Handelsmischungen sind z.B. Phosphatidylcholin-Mischungen. Synthetische Phospholipide sind z.B. Dioctanoylphosphatidylcholin und Dipalmitoylphosphatidylcholin.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation- und/oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen, als auch wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen seien die Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierten Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren (C₁₀-C₂₂), wie z.B. die Na- oder K-Salze der Oel- oder Stearinsäure, oder von natürlichen Fettsäuregemischen, die z.B. aus Kokosnuss- oder Talgöl gewonnen werden können. Ferner sind auch die Fettsäure-methyllaurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sog. synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettsulfonate, Fettsulfate, sulfonierte Benzimidazolderivate oder Alkylsulfonate.

Die Fettsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze vor und weisen einen Alkalirest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschliesst, z.B. das Na- oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecylschwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hierher gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Ethylenoxyd-Addukten. Die sulfonierten Benzimidazolderivate enthalten vorzugsweise 2-Sulfonsäuregruppen und einen Fettsäurerest mit 8-22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z.B. die Na-, Ca- oder Triethanolaminsalze der Dodecylbenzolsulfonsäure, der Dibutylnaphthalinsulfonsäure, oder eines Naphthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate wie z.B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Ethylenoxyd-Adduktes in Frage.

Als nichtionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykoletherderivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage,
die 3 bis 30 Glykolethergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im
(aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome
im Alkylrest der Alkylphenole enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen,
20 bis 250 Aethylenglykoläthergruppen und 10 bis 100 g Propylenglykolethergruppen enthaltenden Polyethylenoxidaddukte an Polypropylenglykol, Aethylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylenglykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette.
Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro PropylenglykolEinheit 1 bis 5 Ethylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyethoxy-ethanole, Ricinusölpolyglykolether, Polypropylen-Polyethylenoxyd-addukte, Tributylphenoxypolyethylenethanol, Polyethylenglykol und Octylphenoxypolyethoxyethanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyethylensorbitan wie das Polyoxyethylensorbitan-trioleat in Betracht.

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quartäre Ammoniumsalze, welche als N-Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Ethylsulfate vor, z.B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder das Benzyldi(2-chlorethyl)ethyl-ammoniumbromid.

Die in der Formulierungstechnik gebräuchlichen Tenside sind u.a. in folgenden Publikationen beschrieben:

"Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" BC Publishing Corp., Ringwood New Jersey, 1981; Helmut Stache "Tensid-Taschenbuch" Carl Hanser-Verlag München/Wien 1981.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99%, insbesondere 0,1 bis 95% Wirkstoff der Formel I, 99,9 bis 1%, insbesondere 99,8 bis 5% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25%, insbesondere 0,1 bis 25% eines Tensides.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbaucher in der Regel verdünnte Mittel.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Derartige agrochemische Mittel sind ein Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

Die nachfolgenden Beispiele dienen zur näheren Erläuterung der Erfindung, ohne dieselbe einzuschränken. Temperaturen sind in Celsiusgraden angegeben. Prozente und Teile beziehen sich auf das Gewicht. Darüberhinaus werden folgende Symbole verwendet:

h = Stunde; RT = Raumtemperatur; DMSO = Dimethylsulfoxid.

Herstellungsbeispiel

Beispiel H1: Herstellung von

$$F_3C \xrightarrow{\bullet \bullet \bullet} NO_2 \qquad NO_2 \qquad NO_3 \qquad (6.1)$$

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-(5-nitro-6-methoxy)-pyrimidin

Eine Lösung von 6,1 Teilen 2,4-Dichlor-3,5-dinitrobenzotrifluorid in 50 ml DMSO wird bei Raumtemperatur unter Rühren portionsweise mit 3,2 Teilen 4-Amino-5-nitro-6-methoxypyrimidin versetzt. Zu der Suspension wird unter Kühlen bei Raumtemperatur innerhalb 1/2 h eine Lösung von 4,5 Teilen Kalium-tert.-butylat in 25 ml DMSO getropft. Nach 12 h Rühren bei Raumtemperatur wird das rot gefärbte Reaktionsgemisch auf 700 ml Eiswasser gegossen, mit 3 ml konzentrierter Salzsäure angesäuert und dreimal mit je 200 ml Chloroform extrahiert. Die vereinigten Extrakte werden zweimal mit je 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingedampft. Die zurückbleibende braune Kristallmasse wird säulenchromatographisch (Kieselgel/

Petrolether: Ethylacetat = 3:2) gereinigt. Nach dem Verdampfen der Laufmittel wird aus Toluol-Cyclohexan umkristallisiert; Smp. 184-186°.

Analog zu den beschriebenen Arbeitsweisen werden auch die nachfolgend aufgeführten Verbindungen der Formel I hergestellt:

Tabelle 1: Verbindungen der Formel

Verb. R	R ₂	R ₃	R ₅ .	Physik. Konstante
1.1 NO 1.2 NO 1.3 NO 1.4 CF 1.5 NO 1.6 NO 1.7 CF 1.8 CF 1.9 NO 1.10 CF 1.11 NO	CF3 CF3 NO2 CF3 CF3 NO2 CF3 CF3 NO2 CF3 NO2 CF3 NO2 CF3	C1 H C1 C1 H C1 H C1	H C ₃ H ₇ -n CH ₃ C ₆ H ₅ C ₃ H ₇ -n C1 C1 C1 C1 C2 C2 SCH ₃ OC2 H ₅ SCH ₃ OCH ₃	Smp.156 zähe Masse zähe Masse

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	Physik. Konstante [°C]
1.12 1.13 1.14 1.15 1.16 1.17 1.18 1.19 1.20 1.21	NO ₂ NO ₂ NO ₂ NO ₂ CF ₃ NO ₂ NO ₂ NO ₂ NO ₂ NO ₂	CF ₃	C1 H C1 H C1 H C1 H C1 C1 H C1	SCH ₃ C1 C ₂ H ₅ CF ₃ CF ₃ CG ₃ CG ₃ H ₇ -i OC ₂ H ₅ CH ₂ OCH ₃ SCH ₂ -C ₆ H ₅ CF ₃ -N(CH ₃) ₂	Harz Harz Harz

Tabelle 2: Verbindungen der Formel

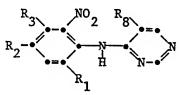
$$\begin{array}{c} R_3 \\ R_2 \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} NO_2 \\ -N-0 \\ H \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} R_6 \\ N-0 \end{array}$$

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	Physik. Kostante [°C]
2.1	NO ₂	CF ₃	н	Н	
2.2	NO ₂	CF ₃	C1	C1	Smp. 97-99
2.3	CF ₃	NO ₂	н	ос ₆ н ₅	
2.4	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₃	Smp. 128-129
2.5	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	Smp. 135-137
2.6	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	Smp. 98-100
2.7	CF ₃	NO ₂	Н	CF ₃	
2.8	NO ₂	CF ₃	C1	-c(cH ₃) ₃	
2.9	CF ₃	NO ₂	Н	C1	Harz

Tabelle 2 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	^R 6	Physik. Konstante [°C]
2.10	NO ₂	CF ₃	C1	-N(C ₂ H ₅) ₂	
2.11	NO ₂	CF ₃	C1	с ₂ н ₅	
2.12	NO ₂	CF ₃	C1	-N(CH ₃) ₂	
2.13	NO ₂	CF ₃	C1	C ₆ H ₅	
2.14	NO ₂	CF ₃	C1	-N	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
2.15	NO ₂	CF ₃	н	-N(C ₃ H ₇ -n) ₂	
2.16	NO ₂	CF ₃	C1	CF ₃	zähe Masse
2.17	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	
2.18	NO ₂	CF ₃	н	OC ₄ H ₉ -n	
2.19	NO ₂	CF ₃	C1	oc ₃ H ₇ -i	
2.20	NO ₂	CF ₃	C1	осн ₃	
2.21	CF ₃	NO ₂	н	OC ₂ H ₅	

Tabelle 3: Verbindungen der Formel

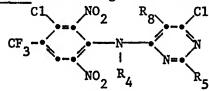


Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₈	Physik. Konstante [°C]
3.1	CF ₃	NO ₂	Н	Н	semikristallin
3.2	NO ₂	CF ₃	C1	CN	
3.3	NO ₂	CF ₃	н	C1	Harz
3.4	NO ₂	CF ₃	C1	Br	
3.5	CF ₃	NO ₂	н	CN	
3.6	NO ₂	CF ₃	C1	C1	

Tabelle 3 (Fortsetzung)

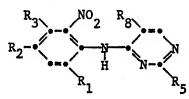
Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₈	Physik. Konstante [°C]
3.7	NO ₂	CF ₃	C1	C1	Harz
3.8	CF ₃	NO ₂	H	Br	,
3.9	NO ₂	CF ₃	C1	c ₃ H ₇ -i	
3.10	NO ₂	CF ₃	C1	CH2OC2H5	
3.11	NO ₂	CF ₃	C1	CH2OC6H5	
3.12	NO ₂	CF ₃	C1	C ₂ H ₅	
3.13	CF ₃	NO ₂	H	СН3	
3.14	NO2	CF ₃	C1	OCH ₃	
3.15	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	
3.16	CF ₃	NO ₂	H	сн ₂ осн ₃	
3.17	NO ₂	CF ₃	C1	C ₆ H ₅	
3.18	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ C ₆ H ₄ C1(4)	
3.19	NO ₂	CF ₃	C1	C ₆ H ₁₃ -n	
3.20	NO ₂	CF ₃	C1	C ₅ H ₄ C1(4)	
3.21	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ C1	
3.22	NO ₂	CF ₃	C1	OC ₆ H ₃ C1 ₂ (3,4)	

Tabelle 4: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₄	R ₈	R ₅
4.1	C(0)CH=CH2	F	SCH3
4.2	C(O)CH=CH ₂	C1	CN
4.3	C(0)CC1=CC1 ₂	F	SCH ₃
4.4	C(0)Cyclopropyl	F	SCH3
4.5	C(0)CH=CH ₂ .	CN	CF ₃
4.6	C(0)C ₆ H ₄ C1(4)	F	SCH ₃
4.7	c(o)-	осн ₃	- CN
4.8	C(0)	F	SCH ₃

Tabelle 5: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	R ₈	Physik. Konst.
5.1	NO ₂	CF ₃	Cl	OCH ₃	Cl	Smp. 157-158
5.2	NO ₂	CF ₃	Cl	CH ₃	C4H9-n	
5.3	NO2	CF ₃	C1	C1	cī	Smp. 176-177
5.4	NO ₂	CF3	C1	Cl	F	Smp. 167-168
5.5	NO ₂	CF3	C1	CH ₃	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
5.6	NO ₂	CF ₃	C1	осн	F	Smp. 158-159
5.7	NO ₂	CF ₃	Cl	SCH ₃	F	
5.8	CF ₃	NO ₂	н	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	
5.9	NO ₂	CF ₃	C1	C ₃ H ₇	CH ₂ Br	
5.10	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₂ Br	
5.11	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	CH ₂ SCN	
5.12	CF ₃	NO ₂	н	-N(CH ₃) ₂	CN	
5.13	NO ₂	CF ₃	C1	Cl	сн ₂ с1	
5.14	CF ₃	NO ₂	Н	CH ₃	CH ₂ CN	
5.15	NO ₂	CF ₃	C1	C ₂ F ₅	CN	
5.16	NO ₂	CF ₃	C1	SO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	*
5.17	CF ₃	NO ₂	H	SCH ₃	CH ₃	
5.18	NO ₂	CF ₃	C1	CF3	CN	Harz
5.19	NO ₂	CF ₃	C1	осн3	CN	
5.20	NO ₂	CF ₃	C1	SC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	
5.21	CF3	NO2	н	CF ₃	CN	
5.22	NO ₂	CF ₃	Cl	C1 C1	OCH ₃	
5.23	NO ₂	CF ₃	C1	CF ₃	CH2OC2H5	
5.24	CF ₃	NO ₂	н	C ₃ F ₇ -n	CN	
5.25	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	
5.26	NO ₂	CF.	C1	SO ₂ CH ₃	CN	

Tabelle 5 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	R ₈	Physik. Konst. [°C]
5.27	NO ₂	CF ₃	C1	-N	NO ₂	
5.28	NO ₂	CF ₃	C1	^C 2 ^F 5	Br	
5.29	NO ₂	CF ₃	C1	CF ₃	CH ₂ Br	
5.30	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	CH ₂ C1	
5.31	NO ₂	CF ₃	C1	sc ₂ H ₅	CN-	~
5.32	CF ₃	NO ₂	н	CF ₃	сн ₂ с1	
5.33	NO ₂	CF ₃	C1	sc ₂ H ₅	F	
5.34	NO ₂	CF ₃	C1	C ₅ H ₉ -n	CN	
5.35	NO ₂	CF ₃	C1	-N(CH ₃) ₂	Br	
5.36	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	NO ₂	
5.37	CF ₃	NO ₂	н	C ₄ H ₉ -n	CN	
5.38	CF ₃	NO ₂	н	C1	NO ₂	
5.39	NO ₂	CF ₃	н	C ₆ H ₄ C1(4)	CN	
5.40	CF ₃	NO ₂	н	SCH ₂ C ₆ H ₅	CN	
5.41	NO ₂	CF ₃	C1	-CH=CH ₂	CN	
5.42	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	CH ₂ Br	
5.43	CF ₃	NO ₂	H	C1	CH ₂ Br	
5.44	NO ₂	CF ₃	н	SCH ₂ C ₆ H ₅	CH-CH=CH ₂	
5.45	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ F	CH ₃	
5.46	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₃	NO ₂	Smp. 178-179
5.47	NO ₂	CF ₃	C1	ос ₂ н ₅	C1	Smp. 149-151
5.48	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	C1	Smp. 146-147
5.49	NO ₂	CF ₃	C1	O(CH ₂) ₂ OCH ₃	NO ₂	Smp. 125-126
5.50	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	NO ₂	Smp. 138-140
5.51	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	F	Smp. 135-138

Tabelle 5 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	R ₈	Physik. Konst.
5.52	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	CH ₃	
5.53	NO ₂	CF ₃	н	SCH ₃	CH ₃	
5.54	NO ₂	CF ₃	н	SCH ₃	C1	
5.55	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₃	CH ₃	
5.56	CF ₃	NO ₂	H .	осн ₃	CH ₃	
5.57	CF ₃	NO ₂	н	C1	CH ₃	
5.58	NO ₂	CF ₃	н	осн ₃	CH ₃	Í
5.59		NO ₂	H ·	OCH ₂ -CH=CH ₂	C1	
5.60	NO ₂	CF ₃	C1	C1	СН _З	
5.61	NO ₂	CF ₃	н	C1	CH ₃	
5.62	CF ₃	NO ₂	н	SCH ₃	C1	
5.63	NO2	CF ₃	н	OCH ₂ CH=CH ₂	C1	
5.64	NO ₂	CF ₃	C1	sch ₃	C1	
5.65	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CH=CH ₂	Ç1	

Tabelle 6: Verbindungen der Formel

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	R ₈	Physik. Konst. [°C]
6.1	NO ₂	CF ₃	C1	осн ₃	NO ₂	Smp. 184-186
6.2	NO ₂	CF ₃	C1	-NH ₂	NO ₂	Smp. 184-189
6.3	CF ₃	NO ₂	н	CH2OC2H5	CH ₃	
6.4	NO2	CF ₃	C1	C1	NO ₂	
6.5	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	CN	
6.6	NO2	CF ₃	C1	-N(C ₃ H ₇ -n) ₂	NO ₂	
6.7	CF ₃	NO ₂	H	OC2H4OC2H5	C ₆ H ₅	

Tabelle 6 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	R ₈	Physik. Konst.
6.8	NO ₂	CF ₃	C1	C1	oc ₄ H ₉ -n	
6.9	NO ₂	CF ₃	C1	F	NO ₂	
6.10	NO ₂	CF ₃	C1	C1	CH ₃	
6.11	NO ₂	CF ₃	C1	Cl	OCH ₃	
6.12	CF ₃	NO ₂	H	oc ₂ H ₅	NO ₂	
6.13	NO ₂	CF ₃	C1	C1	OC ₂ H ₅	
6.14	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	Br	
6.15	CF ₃	NO ₂	н	CH ₃	C1	
6.16	NO ₂	CF ₃	C1	C1	с ₆ н ₅	
6.17	NO ₂	CF ₃	C1	с ₂ н ₄ ос ₂ н ₅	OC ₄ H ₉ -n	*
6.18	NO ₂	CF ₃	C1	C1 C1	oc ₃ H ₇ -i	
6.19	CF ₃	NO ₂	Н	CH ₃	CN	
6.20	CF ₃	NO ₂	H	C1 C1	ос _з н ₇ -і	
6.21	CF ₃	NO.	H	CH ₃	J ,	
6.22	NO ₂	CF ₃	H	C1	ос ₂ н ₅	
6.23	NO2	CF ₃	C1	SCH ₃	NO ₂ -	Smp. 185
6.24	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	NO ₂	Smp. 164-167
6.25	NO ₂	CF ₃	C1	OCH3	C1	
6.26	CF ₃	NO ₂	н	OCH ₂ CF ₃	C1	
6.27	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ -CH=CH ₂	Cl	
6.28	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	C1	
6.29	NO ₂	CF ₃	Н	C1	C1	

Tabelle 7: Verbindungen der Formel

					5		
Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	R ₆	R ₈	Physik. Konst.
7.1	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	осн ₃	NO ₂	Smp. 181-183
7.2	NO ₂	CF ₃	C1	C1	C1	NO ₂	
7.3	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	C1	C ₂ H ₅	Smp. 134-136
7.4	NO ₂	CF ₃	C1	C1	CH ₃	NO ₂	
7.5	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ CN	CH ₂ CN	CN	
7.6	NO2	CF ₃	C1	F	F	F	
7.7	CF ₃	NO ₂	H	C1	C1	NO ₂	
7.8	CF ₃	NO ₂	Н	·C1	C1	Br	
7.9	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	
7.10	NO ₂	CF ₃	C1	C1	C1	Br	
7.11	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	C1	Br	
7.12	NO ₂	CF ₃	C1	C1	C1	CH ₃	Smp. 184-187
7.13	CF ₃	NO ₂	H	SCH ₃	C1	C8H ₁₇ -n	
7.14	CF ₃	NO ₂	H	Br	Br	CH ₃	
7.15	NO ₂	CF ₃	C1	C1	C1	СН ₂ С ₆ Н ₅	
7.16	NO ₂	CF ₃	C1	C1	СН ₃	CH ₃	
7.17	CF ₃	NO ₂	H	CF ₃	CF ₃	CN	
7.18	NO ₂	CF ₃	C1	C1	C1	C1	
7.19	CF ₃	NO ₂	H	C1	C1	CH ₃	Smp. 207-208
7.20	NO ₂	CF ₃	C1	Br	Br	CH ₃	
7.21	NO_2	CF ₃	C1	CH ₃	C1	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
7.22	CF ₃	NO ₂	H	C1	C1	C1 C1	
7.23	CF ₃	NO ₂	H	C1	C1	C2H5	
7.24	CF ₃	NO ₂	H	SCH ₃	CH ₃	NO ₂	
7.25	NO ₂	CF ₃	н	C1	C1	C1	
7.26	NO ₂	CF ₃	C1	-N(CH ₃) ₂	C1	CN	
7.27	NO ₂	CF3	C1	CF ₃	CF ₃	CN	-
		l]			

Tabelle 7 (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₅	R ₆	R ₈	Physik. Konst.
7.28	CF ₃	NO ₂	н	C1 .	CH ₃	С ₂ Н ₅	
7.29	NO ₂	CF ₃	C1	SCH3	OCH ₃	Br	
7.30	NO ₂	CF ₃	C1	SCH	C1	С ₄ ^Н 9 ^{-п}	
7.31	NO ₂	CF ₃	C1	C1 ,	C1	С ₂ Н ₅	
7.32	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	СНЗ	CN	
7.33	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	C1	CH ₃	Smp. 169-172
7.34	NO ₂	CF ₃	C1	CH ₂ OCH ₃	C1	с ₂ н ₅	
7.35	NO ₂	CF ₃	C1		NH ₂	NO,	Smp. 250 (Zers.)
7.36	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₃	och ₃	NO ₂	Smp. 164-166
7.37	NO ₂	CF ₃	Ħ	SCH ₃	C1	CH ₃	Smp. 213-216
7.38	CF ₃	NO ₂	H	SCH ₃	G1	CH ₃	Smp. 150-160
7.39	NO2	CF ₃	C1	CH ₃	CH ₃	J.	
7.40	NO2	CF ₃	Br	CH ₃	CH ₃	II.	•
7.41	CF ₃	NO ₂	H	CH ₃	CH ₃	J	
7.42	NO2	CF ₃	C1	SCH ₃	C1	C1	
7.43	CF ₃	NO2	Н	C_2H_5	осн ₃	C1	
7.44	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₃	C1	C1	
7.45	NO ₂	CF ₃	C1	с ₂ н ₅	SCH ₃	C1	
7.46	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ CF ₃	C1	C1	*
7.47	NO ₂	CF ₃	H	OCH2-CH=CH2	C1	C1	
7.48	NO ₂	CF ₃	C1	С ₂ Н ₅	C1	C1	
7.49	NO ₂	CF ₃	C1	OCH ₂ -CH≡CH	C1	C1	
7.50	NO ₂	CF ₃	C1	C1	CF ₃	C1	
7.51	NO ₂	CF ₃	C1	осн3	CF ₃	C1	
7.52	NO ₂	CF ₃	C1	SCH ₃	CF ₃	C1	

Formulierungsbeispiele	für	flüssige	Wirkstoffe	der	Forma1	т
(% = Gewichtsprozent					TOTMET	<u> </u>

F1. Emulsions-Konzentrate	a)	b)	c)
Wirkstoff aus den Tabellen	25%	40%	50%
Ca-Dodecylbenzolsulfonat	5 %	8%	67
Ricinusöl-polyethylenglykolether (36 Mol Ethylenoxid)	5%	_	-
Tributylphenoyl-polyethylenglykol- ether (30 Mol Ethylenoxid)	-	12%	4%
Cyclohexanon	_	15%	0
Xylolgemisch		13%	20%
, a - 1,	65 %	25%	20%

Aus solchen Konzentraten können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden.

F2. Lösungen	a)	ъ)	c)	.1\
Wirkstoff aus den Tabellen	80%	10%	5 %	d) 95 %
Ethylenglykol-monomethyl-ether	20%	_	_	93k
Polyethylenglykol M G 400	_	70%	_	_
N-Methyl-2-pyrrolidon	-	20%	_	_
Epoxydiertes Kokosnussöl	-	-	17	5 %
Benzin (Siedegrenzen 160-190°C)	-	_	94%	_
(MG = Molekulargewicht)				

Die Lösungen sind zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet.

F3. Granulate	a)	ь)
Wirkstoff aus den Tabellen	5%	10%
Kaolin	94%	_
Hochdisperse Kieselsäure	1%	_
Attapulgit	_	90%

Der Wirkstoff wird in Methylenchlorid gelöst, auf den Träger aufgesprüht und das Lösungsmittel anschliessend im Vakuum abgedampft.

F4. Stäubemittel	a)	ъ)
Wirkstoff aus den Tabellen	2%	5%
Hochdisperse Kieselsäure	17	5%
Talkum	97%	-
Kaolin	•••	90%

Durch inniges Vermischen auf Trägerstoffe mit dem Wirkstoff erhält man gebauchsfertige Stäubemittel.

Formulierungsbeispiele für feste Wirkstoffe der Formel I (% = Gewichtsprozent)

F5. Spritzpulver	a)	ъ)	c)
Wirkstoff aus den Tabellen	25%	50%	75%
Na-Ligninsulfonat	5 %	5%	-
Na-Laurylsulfat	3%	_	5%
Na-Diisobutylnaphthalinsulfonat	-	6 %	10%
Octylphenolpolyethylenglykolether (7-8 Mol Ethylenoxid)	-	2%	-
Hochdisperse Kieselsäure	5 %	10%	10%
Kaolin	62%	27%	104

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen gut vermischt und in einer geeigneten Mühle gut vermahlen. Man erhält Spritzpulver, die sich mit Wasser zu Suspensionen jeder gewünschten Konzentration verdünnen lassen.

F6. Emulsions-Konzentrat

Wirkstoff aus den Tabellen	10%
Octylphenolpolyethylenglykolether (4-5 Mol Ethylenoxid)	3%
Ca-Dodecylbenzolsulfonat	3%
Ricinusölpolyglykolether (35 Mol Ethylenoxid)	4%
Cyclohexanon	30%
Xylolgemisch	50%

Aus diesem Konzentrat können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden.

F7. Stäubemittel	a)	ъ)
Wirkstoff aus den Tabellen	5%	87
Talkum	95 %	-
Kaolin	_	92%

Man erhält anwendungsfertige Stäubemittel, indem der Wirkstoff mit den Träger vermischt auf einer geeigneten Mühle vermahlen wird.

F8. Extruder Granulat

Wirkstoff aus den Tabellen	10%
N-Ligninsulfonat	2%
Carboxymethylcellulose	17
Kaolin	87%

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen vermischt, vermahlen und mit Wasser angefeuchtet. Dieses Gemisch wird extrudiert und anschliessend im Luftstrum getrocknet.

F9. Umhüllungs-Granulat

Wirkstoff aus den Tabellen	3%
Polyethylenglykol (M G 200)	37
Kaolin	94%

(MG = Molekulargewicht)

Der fein gemahlene Wirkstoff wird in einem Mischer auf das mit Polyethylenglykol angefeuchtete Kaolin gleichmässig aufgetragen. Auf diese Weise erhält man staubfreie Umhüllungs-Granulate.

F10. Suspensions-Konzentrat

Wirkstoff aus den Tabellen	40%
Ethylenglykol	10%
Nonylphenolpolyethylenglykolether (15 Mol Ethylenoxid)	6 %
N-Ligninsulfonat	10%
Carboxymethylcellulose	1%
37% ige wässrige Formaldehyd-Lösung	0,2%
Silikonöl in Form einer 75% igen	
wässrigen Emulsion	0,8%
Wasser	32%

Der fein gemahlene Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen innig vermischt. Man erhält so ein Suspensions-Konzentrat, aus welchem durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden können.

Biologische Beispiele:

Beispiel Bl: Wirkung gegen Puccinia graminis auf Weizen

a) Residual-protektive Wirkung

Weizenpflanzen wurden 6 Tage nach der Aussaat mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95-100% relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C wurden die infizierten Pflanzen in einem Gewachshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelnentwicklung erfolgte 12 Tage nach der Infektion.

b) Systemische Wirkung

Zu Weizenpflanzen wurden 5 Tage nach Aussaat eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,006% Aktivsubstanz bezogen auf das Bodenvolumen). Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95-100% relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C wurden die infizierten Pflanzen in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelnentwicklung erfolgte 12 Tage nach der Infektion.

Verbindungen aus den Tabellen zeigten gegen Puccinia-Pilze eine sehr gute Wirkung. Unbehandelte aber infizierte Kontrollpflanzen zeigten einen Puccinia-Befall von 100%. Unter anderen hemmten Verbindungen aus den Tabellen 1, 2, 5 und 7 den Puccinia-Befall auf 0 bis 5 %.

Beispiel B2: Wirkung gegen Cersopora arachidicola auf Erdnusspflanzen

Residual-protektive Wirkung

10-15 cm hohe Erdnusspflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver der Wirksubstanz hergestellten Spritzbrühe (0,006 Aktivsubstanz) besprüht und 48 Stunden später mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die infizierten Pflanzen wurden während 72 Stunden bei ca. 21°C und hoher Luftfeuchtigkeit inkubiert und anschliessend bis zum Auftreten der typischen Blattflecken in einem Gewächshaus aufgestellt.

Die Beurteilung der fungiziden Wirkung erfolgt 12 Tage nach der Infektion basierend auf Anzahl und Grösse der auftretenden `Flecken.

Im Vergleich zu unbehandelten, aber infizierten Kontrollpflanzen (Anzahl und Grösse der Flecken = 100%), zeigten Erdnusspflanzen, die mit Wirkstoffen aus den Tabellen behandelt wurden, einen stark reduzierten Cercospora-Befall. So verhinderten die Verbindungen 1.1, 1.6, 1.7, 1.16, 1.21, 2.2, 2.5, 2.6, 2.9, 2.16, 3.1, 3.3, 3.7, 5.1, 5.3, 5.6, 5.18, 5.46, 5.48, 5.50, 5.51, 6.1, 6.2, 6.23, 6.24, 7.1, 7.3, 7.12, 7.36, 7.37 und 7.38 in obigen Versuchen das Auftreten von Flecken fast vollständig (0-10%).

Beispiel B3: Wirkung gegen Erysiphae graminis auf Gerste

a) Residual-protektive Wirkung

Ca. 8 cm hohe Gerstenpflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,002% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 3-4 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen wurden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

b) Systemische Wirkung

Zu ca. 8 cm hohen Gerstenpflanzen wurde eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,006% Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen wurden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

Verbindungen der Formel I zeigten gute Wirkung gegen Erysiphe-Pilze. Unbehandelte, aber infizierte Kontrollpflanzen zeigten einen Erysiphe-Befall von 100%. Unter anderen Verbindungen aus den Tabellen hemmten die Verbindungen Nr. 1.1, 1.6, 1.7, 1.16, 1.21, 2.2, 2.5, 2.6, 2.9, 2.16, 3.1, 3.3, 3.7, 5.1, 5.3, 5.6, 5.18, 5.46, 5.48, 5.50, 5.51, 6.1, 6.2, 6.23, 6.24, 7.1, 7.3, 7.12, 7.36, 7.37 und 7.38 den Pilzbefall bei Gerste auf weniger als 30%.

Bcispiel B4: Residual-protektive Wirkung gegen Venturia inaequalis auf Apfeltrieben.

Apfelstecklinge mit 10-20 cm langen Frischtrieben wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die Pflanzen wurden dann während 5 Tagen bei 90-100% relativer Luftfeuchtigkeit inkubiert und während 10 weiteren Tagen in einem Gewächshaus bei 20-24°C aufgestellt. Der Schorfbefall wurde 15 Tage nach der Infektion beurteilt. Verbindungen aus den Tabellen hemmten den Krankheitsbefall auf weniger als 25%. Unbehandelte aber infizierte Kontrolltriebe wurden dagegen 100% ig befallen.

Beispiel B5: Wirkung gegen Botrytis cinerea auf Bohnen Residual protektive Wirkung

Ca. 10 cm hohe Bohnen-Pflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 3 Tagen bei 95-100% relativer Luftfeuchtigkeit und 21°C erfolgte die Beurteilung des Pilzbefalls. Die Verbindungen aus der Tabelle hemmten in vielen Fällen die Pilzinfektion sehr stark. Bei einer Konzentration von 0,02% erwiesen sich z.B. die Verbindungen 1.1, 1.6, 1.7, 1.15, 2.4, 2.6, 2.16, 3.3, 3.7, 5.3, 5.6, 5.18, 5.46, 5.49, 6.2, 7.1, 7.12 und 7.33 als voll wirksam. Der Krankheitsbefall lag im allgemeinen bei 0 bis 8%. Der Botrytis-Befall unbehandelter aber infizierter Bohnenpflanzen betrug 100%.

Beispiel B6: Wirkung gegen Phytophthora infestans auf Tomatenpflanzen a) Residual-protektive Wirkung

Tomatenpflanzen wurden nach 3-wöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen
mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die Beurteilung
des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der infizierten
Pflanzen während 5 Tagen bei 90-100% relativer Luftfeuchtigkeit
und 20°C.

b) Systemische Wirkung

Zu Tomatenpflanzen wurde nach 3-wöchiger Anzucht eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,06%
Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf
geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden wurden die behandelten
Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die
Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der
infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 90-100% relativer Luftfeuchtigkeit und 20°C.

Unter anderen zeigten in obigen Versuchen die Verbindungen Nr. 1.1, 1.6, 1.21, 2.2, 2.5, 2.9, 2.16, 3.1, 3.3, 3.7, 5.1, 5.3, 5.46, 5.48, 6.1, 7.1, 7.3 und 7.12 eine sehr gute systemische Wirkung. Gegenüber unbehandelten Kontrollpflanzen (100% Befall) bewirkten diese Verbindungen eine fast vollständige Unterdrückung des Pilzbefalls (0 bis 5%).

Beispiel B7: Wirkung gegen Plasmapora viticola auf Reben a) Residual-protektive Wirkung

Im 4-5 Blattstadium wurden Rebensämlinge mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten
Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert.
Nach einer Inkubation während 6 Tagen bei 95-100% relativer Luft-

feuchtigkeit und 20°C wurde der Pilzbefall beurteilt.

b) Rosidual-kurative Wirkung

Im 4-5 Blattstadium wurden Rebensämlinge mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 24 Stunden
in einer Feuchtkammer bei 95-100% relativer Luftfeuchtigkeit und
20°C wurden die infizierten Pflanzen getrocknet und mit einer aus
Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06%
Aktivsubstanz) besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages
wurden die behandelten Pflanzen wieder in die Feuchtkammer gebracht.
Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte 6 Tage nach der Infektion.

Verbindungen aus den Tabellen zeigten gegen Plasmopara viticola auf Regen eine sehr gute fungizide Wirkung, insbesondere die Wirkstoffe Nr. 1.1, 1.6, 1.7, 1.21, 2.2, 2.5, 2.9, 2.16, 3.1, 3.3, 5.1, 5.3, 5.4, 6.1, 6.2, 7.1, 7.12 und 7.19 bewirkten eine vollständige Unterdrückung des Pilzbefalls (0 bis 5 %).

Beispiel B8: Wirkung gegen Piricularia oryzae auf Reispflanzen Residual-protektive Wirkung

Reispflanzen wurden nach zweiwöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen
mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach 5 Tagen
Inkubation bei 95-100% relativer Luftfeuchtigkeit und 24°C wurde
der Pilzbefall beurteilt.

Reispflanzen, die mit einer Spritzbrühe behandelt worden sind, die als Aktivsubstanz eine Verbindung aus den Tabellen 2 oder 7, wie z.B. Nr. 7.1 und 7.19 enthielt, zeigten im Vergleich zu unbehandelten Kontrollpflanzen (100% Befall) weniger als 10% Pilzbefall.

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel I

worin

 R_1 für NO_2 oder CF_3 steht;

R₂ für NO₂ oder CF₃ steht;

R, Wasserstoff oder Halogen bedeutet;

R₄ Wasserstoff oder die Gruppe -C(0)R₇ steht; wobei

R₇ einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl und Heterocyclyl repräsentiert;

R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(0)_n stehen, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander Wasserstoff oder einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl und Phenyl darstellen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden;

n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet;

R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Heterocyclyl stehen; darüberhinaus R₅ für Wasserstoff, R₆ für Wasserstoff oder zwei der Reste R₅, R₆ und R₈ für Wasserstoff stehen können.

2. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Halogen

bedeutet; R_4 für Wasserstoff oder die Gruppe -C(0) R_7 steht; wobei R₇ unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C4-Alkenyl, C3-C6-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro oder C1-C3-Alkyl substituiertes Phenyl oder einen unsubstituierten oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder Nitro substituierten, ungesättigten oder gesättigten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen repräsentiert; R_5 , R_6 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0)_n stehen, wobei R_9 und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₁₂-Alky1, C₃-C₆-Alkeny1, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigten, unsubstituierten oder durch Halogen, $C_1^{-C_4}$ -Alkyl oder $C_1^{-C_4}$ -Alkoxy substituierten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatomen enthalten kann; n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder cyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C1-C4-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Haloalky1, C₁-C₄-Alky1 oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alky1, C₁-C₄-Haloalky1 oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei

Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R_5 für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R_5 , R_6 und R_8 für Wasserstoff stehen können.

3. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 2, worin R für NO oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Halogen bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0)_n stehen, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₁₂-Alky1, C₃-C₆-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigten, unsubstituierten oder durch Halogen, C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy substituierten, fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatome enthalten kann; n eine der Zahlen O, 1 oder 2 bedeutet; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder cyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alky1, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C1-C3-Alkyl substituiertes C3-C7-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C1-C4-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen, unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R_5 für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R_5 , R_6 und R_8 für Wasserstoff stehen können.

- 4. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, worin R_1 für NO_2 oder ${
 m CF_3}$ steht; ${
 m R_2}$ für ${
 m NO_2}$ oder ${
 m CF_3}$ steht; ${
 m R_3}$ Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₅ für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(O)_n steht, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C3-C4-Alkenyl, unsubstituierts oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiert ist; für C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1 - C_2 -Alkyl, CF_3 oder c_1^{-c} -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_6 und R_8 Wasserstoff bedeuten.
- 5. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 für Wasserstoff steht; R_6 für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0) steht, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_3 -Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy

oder Phenylthio substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch Halogen, CF_3 , C_1 - C_2 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_8 Wasserstoff bedeutet.

6. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄, R₅ und R₆ für Wasserstoff stehen; und R₈ Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-0- oder R₁₃-S(0)_n repräsentiert, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2, steht; und R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cyclo-alkyl oder unsubstituiertes oder durch Halogen, CF₃, C₁-C₂-Alkyl oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen.

7. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, worin R, für NO2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(Rq)(R10), -R₁₁, R₁₂-O- oder R₁₃-S(0)_n steht, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Ring ausgewählt aus der Reihe Piperidin, Tetrahydrofuryl und Morpholin bilden; n für die Zahl 2 steht; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C3-C4-Alkylen, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen, heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes C1-C12-Alkyl, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituier: oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiert ist; für C₃-C₄-Alkinyl,

 $^{\rm C_3-C_6-Cycloalkyl}$, unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, $^{\rm C_1-C_2-Alkyl}$, CF $_3$ oder $^{\rm C_1-C_2-Alkoxy}$ substituiertes Phenyl stehen; und R $_6$ Wasserstoff bedeutet.

- 8. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, worin R_1 für NO_2 oder CF3 steht; R2 für NO2 oder CF3 steht; R3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0)_n steht, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes ${
 m c_1^{-C_4^{-Alkyl}}}$, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiert ist; für C3-C4-Alkinyl, C3-C6-Cycloalkyl, unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C1-C2-Alkyl, CF3 oder C1-C2-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_5 Wasserstoff bedeutet.
- 9. Eine Verbindung der Formel I, ausgewählt aus der Reihe:
 N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-chlorpyrimidin (Nr. 2.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-methylmercapto-pyrimidin (Nr. 2.5);

```
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-maino-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 2.4);
```

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-(2,2,2-trifluorethoxy)-pyrimidin (Nr. 2.6);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methoxy-5-chlor-pyrimidin (Nr. 5.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2,5-dichlor-pyrimidin (Nr. 5.3);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-chlor-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.4);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methoxy-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.6);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 6.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-amino-pyrimidin (Nr. 6.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methyl-mercapto-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 7.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-ami no-2-methyl-5-ethyl-6-chlor-pyrimidin (Nr. 7.3);

10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II

$$R_{2} \xrightarrow{\text{NO}_{2}} R_{1}$$
(II)

in Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III

$$\begin{array}{c}
R_{8} \\
Y - \bullet \\
N - \bullet
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R_{5}
\end{array}$$
(III)

zu einer Verbindung der Formel I'

$$R_{2} \xrightarrow{R_{0}} NO_{2} \qquad R_{8} \xrightarrow{R_{6}} NO_{1} \qquad (I')$$

umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV

N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_8 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

ll. Mittel zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls durch Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass es neben üblichen Zuschlagstoffen als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I enthält. 12. Verfahren zur Bekämpfung oder Verhügung eines Befalls von Kulturpflanzen durch phytopathogene Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel I auf die Pflanze oder deren Standort appliziert.

Patentansprüche für Oesterreich

1. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I

$$R_{2} \xrightarrow{R_{1}} NO_{2} \xrightarrow{R_{8}} R_{6}$$

$$R_{1} \xrightarrow{R_{4}} N \xrightarrow{R_{5}} N$$
(1),

worin

R₁ für NO₂ oder CF₃ steht;

R₂ für NO₂ oder CF₃ steht;

R₃ Wasserstoff oder Halogen bedeutet;

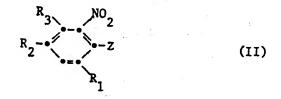
R₄ Wasserstoff oder die Gruppe -C(0)R₇ steht; wobei

R₇ einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl und Heterocyclyl repräsentiert;

R₅, R₆ und R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂-0- oder R₁₃-S(O)_n stehen, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander Wasserstoff oder einen unsubstituierten oder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl und Phenyl darstellen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden;

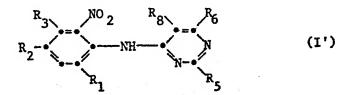
n eine der Zahlen 0, 1 oder 2 bedeutet;

R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für einen unsubstituierten woder substituierten Rest aus der Reihe C₁-C₂-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, Phenyl oder Heterocyclyl stehen; darüberhinaus R₅ für Wasserstoff, R₆ für Wasserstoff oder zwei der Reste R₅, R₆ und R₈ für Wasserstoff stehen können, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II



in Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III

zu einer Verbindung der Formel I'



umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV

N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_8 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

2. Verfahren nach Anspruch 1, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder Halogen bedeutet; R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe -C(0)R₇ steht; wobei R₇ unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C₂-C₄-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes Phenyl oder einen unsubstituierten oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder Nitro substituierten, ungesättigten oder gesättigten, fünf-

bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen repräsentiert; R5, R6 und R8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0)_n stehen, wobei R_9 und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, $C_1 - C_4$ -Alkyl oder $C_1 - C_4$ -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigten, unsubstituierten oder durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatomen enthalten kann; n eine der Zahlen O, 1 oder 2 bedeutet; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder cyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C1-C4-Alkyl, $^{\rm C_1-C_4-Haloalkyl}$ oder $^{\rm C_1-C_4-Alkoxy}$ substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy sub**s**tituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R_5 für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R_{5} - R_{6} und R_{8} für Wasserstoff stehen können.

3. Verfahren nach Anspruch 2, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht. R_2 für NO_2 oder CF_3

steht; R_3 Wasserstoff oder Halogen bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 , R_6 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0) stehen, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, unsubstituiertes oder durch Hydroxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_1 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen mit dem Stickstoffatom gemeinsam einen ungesättigten oder gesättigten, unsubstituierten oder durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituierten, fünfbis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring bilden, der noch ein oder zwei zusätzliche Heteroatome enthalten kann;

unabhängig voneinander für unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C2-C6-Alkenyl; unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen gesättigten oder ungesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, wobei jeder cyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Haloalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist; unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C3-C6-Alkinyl; unsubstituiertes oder durch Halogen oder C₁-C₃-Alkyl substituiertes C3-C7-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, C1-C4-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder für einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- bis sechsgliedrigen, unsubstituierten oder durch Halogen, Nitro, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Haloalkyl oder C1-C4-Alkoxy substituierten heterocyclischen Ring mit ein bis drei Heteroatomen stehen; und darüberhinaus R, für Wasserstoff, R_6 für Wasserstoff oder zwei der Reste R_5 , R_6 unc. R_8 für Wasserstoff stehen können.

4. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Wasserstoff oder

Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R₉)(R₁₀), -R₁₁, R₁₂ -O- oder R₁₃ -S(0) steht, wobei R₉ und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituierts oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes $c_{1}^{-c}c_{12}^{-Alkyl}$, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiert ist; für C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1 - C_2 -Alkyl, CF_3 oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_6 und R_8 Wasserstoff bedeuten.

- 5. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0) $_n$ steht, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_3 -Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2 steht; R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C_3 - C_4 -Alkenyl unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch Halogen, CF_3 , C_1 - C_2 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_8 Wasserstoff bedeutet.
- 6. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 , R_5 und R_6 für Wasserstoff

stehen; und R_8 Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10})$, $-R_{11}$, R_{12} -0- oder R_{13} -S(0) repräsentiert, wobei R_9 und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_3 -Alkyl oder zusammen mit dem Stickstoffatom für Piperidin stehen; n für die Zahl 2 steht; und R_{11} , R_{12} und R_{13} unabhängig voneinander für C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch Halogen, CF_3 , C_1 - C_2 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen.

7. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 und R_8 unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen -N(R_9)(R_{10}), R_{11} , R_{12} -O- oder R_{13} -S(0)_n steht, wobei R_9 und R₁₀ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄₋ Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Ring ausgewählt aus der Reihe Piperidin, Tetrahydrofuryl und Morpholin bilden; n für die Zahl 2 steht; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen, heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes C1-C12-Alkyl, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF3 oder Methoxy substituiert ist; für C3-C4-Alkinyl, C3-C6-Cycloalkyl, unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, C1-C2-Alkyl, CF₃ oder C₁-C₂-Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R₆ Wasserstoff bedeutet.

8. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Wasserstoff oder Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_6 und

R₈ unabhängig voneinander für Halogen, Cyano, Rhodano, Nitro oder eine der Gruppen $-N(R_9)(R_{10}^9, -R_{11}, R_{12}, -0- \text{ oder } R_{13}^9 -S(0)_n \text{ steht, wobei } R_9$ und R_{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_4 -Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl stehen oder zusammen einen unsubstituierten oder durch Methyl substituierten Piperidinring bilden; n für die Zahl 2 steht; R₁₁, R₁₂ und R₁₃ unabhängig voneinander für C₃-C₄-Alkenyl, unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Cyano, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio oder durch einen ungesättigten oder gesättigten, fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Ring mit ein oder zwei Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel substituiertes C₁-C₄-Alkyl, wobei jeder heterocyclische Rest seinerseits unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF3 oder Methoxy substituiert ist; für C₃-C₄-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiert oder durch Halogen, Nitro, c_1-c_2 -Alkyl, c_3 oder c_1-c_2 -Alkoxy substituiertes Phenyl stehen; und R_5 Wasserstoff bedeutet.

9. Verfahren nach Anspruch 1, zur Herstellung einer Verbindung der Formel I, ausgewählt aus der Reihe:

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-6-chlor-pyrimidin (Nr. 2.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylpheny1)-4-amino-6-methylmercapto-pyrimidin (Nr. 2.5);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-maino-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 2.4);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylpheny1)-4-amino-6-(2,2,2-trifluorethoxy)-pyrimidin (Nr. 2.6);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methoxy-5-chlor-pyrimidin (Nr. 5.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2,5-dichlor-pyrimidin (Nr. 5.3);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-chlor-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.4);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methoxy-5-fluor-pyrimidin (Nr. 5.6);

N-(3*-Chlor-2*,6*-dinitro-4*-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 6.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-5-nitro-6-amino-pyrimidin (Nr. 6.2);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methyl-mercapto-5-nitro-6-methoxy-pyrimidin (Nr. 7.1);

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-4-amino-2-methyl-5-ethyl-6-chlor-pyrimidin (Nr. 7.3);

10. Mittel zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls durch Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass es neben üblichen Zuschlagstoffen als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 enthält.

11. Mittel gemäss Anspruch 10 dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 2 enthält.

- 12. Mittel zur Bekämpfung von Mikroorganismen gemäss Anspruch 10 dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss einem der Ansprüche 3 bis 9 enthält.
- 13. Mittel nach Anspruch 12 dadurch gekennzeichnet, dass es 0,1 bis 99% eines Wirkstoffs der Formel I, 99,9 bis 1% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25% eines Tensides enthält.
- 14. Mittel nach Anspruch 13 dadurch gekennzeichnet, dass es 0,1 bis 95% eines Wirkstoffs der Formel I, 99,8 bis 5% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0,1 bis 25% eines Tensids enthält.
- 15. Verfahren zur Herstellung eines wie in Anspruch 10 beanspruchten agrochemischen Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine gemäss Anspruch 1 definierte Verbindung der Formel I mit geeigneten festen oder flüssigen Zusatzstoffen und Tensiden innig vermischt.
- 16. Verfahren zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls von Kulturpflanzen durch phytopathogene Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass man eine gemäss Anspruch 1 definierte Verbindung der Formel I auf die Pflanze oder deren Standort appliziert.
- 17. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1 zur Bekämpfung und/oder präventiven Verhütung eines Befalls von Mikroorganismen.



EPA Form 1503 03.82

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

		ÄGIGE DOKUMENTE		EP 84810417.0
Kategorie	Kennzeichnung des Doku der n	iments mit Angabe, soweit erforderlich, na8geblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)
A	<u>EP - A1 - 0 067</u> * Ansprüche		1,10	C 07 D 239/47 C 07 D 239/42
A	EP - A1 - 0 057 * Ansprüche fassung *	440 (SANKYO) 1,22; Zusammen-	1,10,	C 07 D 239/48 C 07 D 239/48 C 07 D 239/28 A 01 N 43/54
				RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Ci.4)
			-	
Derv	orliegende Recherchenbericht wu	rde für alle Patentansprüche erstellt.		•
K: von	Recherchenort WIEN FEGORIE DER GENANNTEN D besonderer Bedeutung allein besonderer Bedeutung in Ver	betrachtet nach	es Patentdokume	Prüfer HOCHHAUSER nt, das jedoch erst am oder um veröffentlicht worden ist
A: tech O: nich P: Zwis	besonderer Bedeutung in Ver eren Veröffentlichung derselb nologischer Hintergrund tschriftliche Offenbarung ichenliteratur Erfindung zugrunde liegende	bindung mit einer D: in de L: aus a	r Anmeldung ang andern Gründen a	eführtes Dokument